

(57) **Abstract:** The invention relates to new C-19-halogen-substituted steroids of the androst-9(11)-ene series, namely 17 $\beta$ -hydroxy-19-halogen-androsta-4,9(11)-dien-3-ones of general formula (I) and process for their production. In addition, the use of new radiohalogen-labeled compounds of Formula (I) as radiopharmaceutical agents is the subject of the invention as well as the use of non-labeled compounds of Formula (I) as starting products for the production of new biologically active 5 $\beta$ -substituted androst-9(11)-enes of general formula (II) and the new 6 $\beta$ ,19-cycloandrostadienes of Formula (III) as well as processes for their production and their use.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
25. Januar 2001 (25.01.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 01/05805 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07J 1/00,  
A61K 31/565, G01N 33/60, C07J 51/00, 53/00, 21/00,  
71/00, 43/00, A61P 5/36, 5/32

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/DE00/02390

(22) Internationales Anmeldedatum:  
17. Juli 2000 (17.07.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
199 34 088.9 15. Juli 1999 (15.07.1999) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT**  
[DE/DE]; Müllerstrasse 178, D-13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **NEEF, Günter**  
[DE/DE]; Markgraf-Albrecht-Strasse 4, D-10711  
Berlin (DE). **GOLDE, Roland** [DE/DE]; Schönfliesser  
Strasse 24, D-16562 Bergfelde (DE). **FRITZEMEIER,**  
**Karl-Heinrich** [DE/DE]; Rabenstrasse 5a, D-13505  
Berlin (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DK,  
DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL,  
IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,  
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT,  
RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eura-  
sisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI,  
FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent  
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

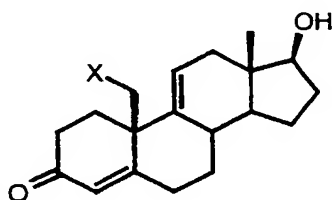
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 13. September 2001

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: NOVEL C-19-HALOGEN-SUBSTITUTED, 5-SUBSTITUTED, 5-SUBSTITUTED OR 6,10 CARBOCYCLICALLY  
CONDENSED STEROIDS OF THE ANDROST-9(11)-ENE-SERIES, METHODS FOR THE PRODUCTION AND USE  
THEREOF

(54) Bezeichnung: NEUE C-19-HALOGENSUBSTITUIERTE, 5-SUBSTITUIERTE, 5-SUBSTITUIERTE ODER 6,10-CARBO-  
ZYKLISCH-KONDENSIERTE STEROIDE DER ANDROST-9(11)-EN-REIHE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG SO-  
WIE IHRE VERWENDUNG



(57) Abstract: The invention relates to novel C-19-halogen-substituted steroids of the an-  
drost-9(11)-ene series, i.e. 17 $\beta$ -hydroxy-19-halogen-androsta-4,9(11)-diene-3-one of ge-  
neral formula (I) and to methods for the production thereof. The invention also relates to the  
use of novel radiohalogen-marked compounds of formula I as radiopharmaceuticals. The  
invention further relates to non-marked compounds(I) of formula I as initial products for  
the production of novel biologically effective 5 $\beta$ -substituted Androst-9(11)-enes of general  
formula (II) and novel 6 $\beta$  19-cycloandrostadienes of formula (III), in addition to methods  
and uses thereof.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue C-19-halogensubstituierte Steroide der Androst-9(11)-en-Reihe, nämlich 17 $\beta$ -  
Hydroxy-19-halogen-androsta-4,9(11)-dien-3-one der allgemeinen Formel (I), und Verfahren zu ihrer Herstellung. Des weiteren ist  
die Verwendung der neuen radiohalogen-markierten Verbindungen der Formel (I), als Radiopharmaka Gegenstand der Erfindung  
sowie die Verwendung der nichtmarkierten Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsprodukte zur Herstellung von neuen biologisch  
wirksamen 5 $\beta$ -substituierten Androst-9(11)-enen der allgemeinen Formel (II) und der neuen 6 $\beta$ , 19-Cycloandrostadiene der Formel  
(III) sowie Verfahren zu deren Herstellung und ihre Verwendung.

WO 01/05805 A3